



Europäisches
Patentamt

European
Patent Office

Office européen
des brevets

J1011 U.S. PTO
10/044373
01/11/02

Bescheinigung

Certificate

Attestation

Die angehefteten Unterlagen stimmen mit der ursprünglich eingereichten Fassung der auf dem nächsten Blatt bezeichneten europäischen Patentanmeldung überein.

The attached documents are exact copies of the European patent application described on the following page, as originally filed.

Les documents fixés à cette attestation sont conformes à la version initialement déposée de la demande de brevet européen spécifiée à la page suivante.

Patentanmeldung Nr. Patent application No. Demande de brevet n°

01100764.8

Der Präsident des Europäischen Patentamts;
Im Auftrag

For the President of the European Patent Office

Le Président de l'Office européen des brevets
p.o.

I.L.C. HATTEN-HECKMAN

DEN HAAG, DEN
THE HAGUE,
LA HAYE, LE

29/10/01

Best Available Copy



**Blatt 2 der Bescheinigung
Sheet 2 of the certificate
Page 2 de l'attestation**

Anmeldung Nr.:
Application no.:
Demande n°: 01100764.8

Anmeldetag:
Date of filing: 12/01/01
Date de dépôt:

Anmelder:
Applicant(s):
Demandeur(s):
Novartis AG
4056 Basel
SWITZERLAND

Bezeichnung der Erfindung:
Title of the invention:
Titre de l'invention:
Kontaktlinsenpflegemittel

In Anspruch genommene Priorität(en) / Priority(ies) claimed / Priorité(s) revendiquée(s)

Staat:
State:
Pays:

Tag:
Date:
Date:

Aktenzeichen:
File no.
Numéro de dépôt:

Internationale Patentklassifikation:
International Patent classification:
Classification internationale des brevets:
/

Am Anmeldetag benannte Vertragsstaaten:
Contracting states designated at date of filing: AT/BE/CH/CY/DE/DK/ES/FI/FR/GB/GR/IE/IT/LI/LU/MC/NL/PT/SE/TR
Etats contractants désignés lors du dépôt:

Bemerkungen:
Remarks:
Remarques:

Der Name und Adresse des Anmelders lauteten zum Zeitpunkt der Einreichung der Anmeldung : Novartis AG., Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel.
Die Eintragung der geänderten Daten ist mit Wirkung vom 11.06.2001 erfolgt.

Novartis AG
Basel, Schweiz
u.Z.: F 1052 EP

VOSSIUS & PARTNER
PATENTANWÄLTE
SIEBERTSTR. 4
81675 MÜNCHEN

12. Jan. 2001

- 1 -

Kontaktlinsenpflegemittel

EPO - Munich
24

12 Jan. 2001

Die vorliegende Erfindung betrifft ein Kontaktlinsenpflegemittel für harte und weiche Kontaktlinsen enthaltend Dexpanthenol.

Dexpanthenol, ein Alkohol der Panthothensäure, auch ProVitamin B5, D-Panthenylalkohol oder D-Panthenol genannt, wird schon seit langem zur Wundheilung oder im Rahmen der medizinischen Hautpflege eingesetzt. Es wurde nun überraschend gefunden, dass Dexpanthenol auch sehr wirkungsvoll als Bestandteil in Kontaktlinsenpflegemitteln eingesetzt werden kann. Die Verbindung besitzt eine gute Reinigungswirkung und stabilisiert ausserdem den Tränenfilm nach dem Einsetzen der Kontaktlinsen. Durch das Einsetzen der Kontaktlinsen entstehen nämlich aufgrund einer mechanischen Eruption - oder durch gegebenenfalls in der Kontaktlinsenlösung vorhandene oberflächenaktive Substanzen hervorgerufen - Verwirbelungen der Tränenflüssigkeit, welche zu einem starken Verlust der wässrigen Tränenschicht führen können. Es wurde gefunden, dass Dexpanthenol den Tränenfilm stabilisiert und einen stärkeren Verlust der wässrigen Schicht verhindert. Dies beugt Trockenheitserscheinungen, welche zu einem reduzierten Tränenfilm führen können, vor.

Gegenstand der vorliegenden Erfindung ist daher ein Kontaktlinsenpflegemittel enthaltend Dexpanthenol. Die Erfindung bezieht sich ebenfalls auf die Verwendung von Dexpanthenol zur Reinigung und Desinfektion von Kontaktlinsen.

Dexpanthenol wird in den erfindungsgemässen Kontaktlinsenpflegemitteln vorzugsweise in einer Menge, bezogen auf die Gesamtmenge des vorteilhafterweise in wässriger Lösung formulierten Kontaktlinsenpflegemittels, von ca. 0,2 bis 10 Gewichtsprozent, insbesondere in einer Menge von ca. 0,5 bis 5 Gewichtsprozent, besonders bevorzugt in einer Menge von ca. 0,5 bis 4 Gewichtsprozent, und insbesondere bevorzugt in einer Menge von 1 bis 3 Gewichtsprozent, verwendet.

- 2 -

Die erfindungsgemässen Kontaktlinsenpflegemittel enthalten vorteilhaft neben Dexpanthenol und Wasser einen oder mehrere weitere Bestandteile, z.B. Puffersubstanzen, die Tonizität beeinflussende Substanzen, oberflächenaktive Substanzen, die Viskosität beeinflussende Substanzen, Komplexierungsmittel, und/oder antimikrobielle Verbindungen. Obwohl im allgemeinen nicht notwendig, kann auch eine enzymatische Reinigungssubstanz in den erfindungsgemässen Kontaktlinsenpflegemitteln anwesend sein. Die Mengen, in denen diese oder weitere übliche Zusatzstoffe in den erfindungsgemässen Kontaktlinsenpflegemitteln enthalten sind, bewegen sich im Rahmen der dem Fachmann geläufigen Werte.

Die erfindungsgemässen Kontaktlinsenpflegemittel werden vorzugsweise so formuliert, dass sie mit der Tränenflüssigkeit isotonisch sind.

Unter einer Lösung, die mit der Tränenflüssigkeit isoton ist, wird allgemein eine Lösung verstanden, deren Konzentration der Konzentration einer 0,9 %-igen Kochsalzlösung entspricht. Abweichungen hiervon sind durchaus möglich, solange die zu behandelnden Kontaktlinsen dabei nicht geschädigt werden. Die Isotonie mit der Tränenflüssigkeit oder auch eine andere gewünschte Tonizität kann durch Zugabe von organischen oder anorganischen die Tonizität beeinflussenden Substanzen eingestellt werden. Erstere können z.B. in Mengen von etwa 1 bis 4,5 Gewichtsprozent verwendet werden, letztere in Mengen von etwa 0,1 bis 1,3 Gewichtsprozent. Generell wird soviel der die Tonizität beeinflussenden Substanz zugegeben, dass die Tonizität der erfindungsgemässen Zusammensetzung insbesondere im Bereich von 200 bis 450 Milliosmol liegt, vorzugsweise im Bereich von etwa 270 bis etwa 330 Milliosmol. Typische organische Substanzen dieser Art sind beispielsweise Glycerin, Harnstoff, Propylenglykol oder Zucker wie Mannit oder Sorbit, typische anorganische Substanzen dieser Art sind insbesondere Kaliumchlorid oder Natriumchlorid. Auch Gemische dieser Verbindungen miteinander können erfindungsgemäss verwendet werden.

Geeignete oberflächenaktive Substanzen sind beispielsweise in der EP-A2-180,309 genannt. Als besonders geeignete Vertreter, die erfindungsgemäss verwendet werden können, seien hier beispielsweise Poloxamer-Typen oder Miranol-Typen genannt. Weitere Vertreter sind dem Fachmann bekannt. Diese Substanzen können beispielsweise in

Mengen von bis zu 20 Gewichtsprozent, insbesondere in Mengen von 0,4 bis 5 Gewichtsprozent verwendet werden.

Geeignete die Viskosität beeinflussende Substanzen sind dem Fachmann ebenfalls bekannt. Als besonders geeignete Vertreter, die erfindungsgemäss verwendet werden können, seien hier beispielsweise Polyvinylalkohol, Hydroxyethylcellulose, Hydroxypropylmethylcellulose oder Polyacrylsäure genannt. Typische Mengen für diese Substanzen sind 0,1 bis 2 Gewichtsprozent.

Ein besonders geeigneter Komplexbildner ist insbesondere Ethylendiamintetraessigsäure, kurz EDTA, respektive Salze davon, wie Natriumsalze. Typische Mengen für diese Substanzen sind 0,01 bis 1 Gewichtsprozent.

Eine Gruppe von geeigneten antimikrobiellen Mitteln stellen quarternäre Ammoniumsalze dar. Ein anderes Beispiel für bevorzugte antimikrobielle Mittel sind Biguanide, z.B. Hexamethylen-Biguanide oder wasserlösliche Polymere, z.B. ein Polyaminopropyl-Biguanid, oder ein geeignetes Salz davon. Ein bevorzugtes antimikrobielles Mittel ist PHMB (Polyhexamethylen-Biguanid).

Das antimikrobielle Mittel wird in den erfindungsgemässen Kontaktlinsenpflegemitteln vorzugsweise in einer Menge, bezogen auf die Gesamtmenge des Kontaktlinsenpflegemittels, von 0,1 bis 100 ppm (0,00001 - 0,01 Gewichtsprozent) verwendet, insbesondere in einer Menge von 0,5 bis 50 ppm (0,00005 - 0,005 Gewichtsprozent) und besonders bevorzugt in einer Menge von 1 bis 10 ppm (0,0001 - 0,001 Gewichtsprozent), z.B. 1, 2 oder 5 ppm, verwendet.

Im Rahmen der vorliegenden Erfindung ist unter einem geeigneten Salz generell ein wasserlösliches Salz, das vorteilhafterweise ophthalmologisch annehmbar ist, zu verstehen. Geeignete Salze sind solche mit anorganischen oder organischen Säuren, beispielsweise Hydrochloride, Hydrobromide, Borate, Acetate, Gluconate, Sulfonate, Maleate, Ascorbate, Tartrate oder Citrate.

Geeignete Puffersubstanzen als Bestandteil der erfindungsgemässen Kontaktlinsenpflegemittel sind dem Fachmann bekannt. Beispiele sind Borsäure, Borate, z.B.

- 4 -

Natriumborat, Citronensäure, Citrate, z.B. Kaliumcitrat, Bicarbonate, z.B. Natriumbicarbonat, TRIS, Trometamol, Phosphatpuffer, z.B. Na_2HPO_4 , NaH_2PO_4 , und KH_2PO_4 oder Gemische davon.

Der pH-Wert der Pflegemittel weist vorzugsweise einen Wert von z.B. 5 bis 8, vorzugsweise von 6 bis 8 oder besonders bevorzugt von 7 bis 7,6 auf.

Die erfindungsgemässen Kontaktlinsenpflegemittel sind für alle Arten von Kontaktlinsen geeignet. Darunter fallen insbesondere die sogenannten harten und weichen Kontaktlinsen, aber auch die sogenannten hart-flexiblen oder hoch-gasdurchlässigen Kontaktlinsen. Die erfindungsgemässen Kontaktlinsenpflegemittel weisen eine reinigende Wirkung und darüber hinausgehend gegebenenfalls eine antimikrobielle Wirkung auf. Je nach speziell beabsichtigtem Verwendungszweck können die erfindungsgemässen Kontaktlinsenpflegemittel als Reinigungsmittel, als Desinfektionsmittel, oder z.B. als Lösung zur Aufbewahrung, zum Abspülen, Befeuchten oder Einweichen von Kontaktlinsen eingesetzt werden. Alle diese Lösungen zeichnen sich durch eine gute Verträglichkeit aus.

Die erfindungsgemässen Kontaktlinsenpflegemittel werden auf an sich bekannte Weise hergestellt, insbesondere durch konventionelles Vermischen der Bestandteile mit Wasser bzw. Lösen der Bestandteile in Wasser.

Die erfindungsgemässen Zusammensetzungen sind insbesondere zur Reinigung und gegebenenfalls zur Desinfektion von Kontaktlinsen geeignet. Die erfindungsgemässen Kontaktlinsenpflegemittel werden auf an sich bekannte Art und Weise verwendet, z.B. indem eine Kontaktlinse mit dem Kontaktlinsenpflegemittel für eine Zeitspanne in Kontakt gebracht wird, die für eine Reinigung oder Desinfektion ausreichend ist. Je nach Linsentyp und Verschmutzungsgrad ist hierfür eine Zeitspanne von einigen Minuten bis zu etwa 24 Stunden, bevorzugt bis zu etwa 4 bis 12 Stunden, ausreichend.

Eine bevorzugte erfindungsgemässe Lösung enthält beispielsweise Dexpanthenol, eine oder mehrere Puffersubstanzen, PHMB, Kochsalz oder Kallumchlorid und ein Komplexmierungsmittel, bevorzugt EDTA.

Eine besonders bevorzugte erfindungsgemässe Lösung enthält z.B.:

Dexpanthenol	5 bis 20 g/l
NaCl oder KCl	3 bis 9 g/l
PHMB	0,0005 bis 0,05 g/l
EDTA	0,1 bis 2 g/l

sowie Puffersubstanzen, die einen pH-Wert von 6 bis 8 stabilisieren und Wasser.

Eine weitere besonders bevorzugte erfindungsgemässe Lösung enthält z.B.:

Dexpanthenol	5 bis 20 g/l
NaCl oder KCl	3 bis 9 g/l
PHMB	0,0005 bis 0,05 g/l
EDTA	0,1 bis 2 g/l

sowie Puffersubstanzen, die einen pH-Wert von 6 bis 8 stabilisieren, z.B. Na_2HPO_4 , NaH_2PO_4 , TRIS, und Wasser.

Ferner können die obengenannten bevorzugten Lösungen enthalten:

oberflächenaktive Substanz	0,1 bis 2 g/l
die Viskosität beeinflussende Verbindung	0,1 bis 2 g/l

Die nachfolgenden Beispiele dienen der Erläuterung der Erfindung. Sie sollen den Gegenstand der Erfindung jedoch in keiner Weise einschränken, insbesondere nicht auf den Gegenstand der Beispiele.

Beispiel 1: Formulierung für ein Kontaktlinsenmittel

Ein Kontaktlinsenpflegemittel wird durch Zusammenmischen der folgenden Komponenten hergestellt:

Dexpanthenol	10,0 g/l
EDTA	1,0 g/l
Natriumchlorid	7,0 g/l
TRIS Amino	2,5 g/l
Methocel E5	0,5 g/l
PHMB	0,001 g/l
Aqua Purificata	ad 1000 ml.

- 6 -

Beispiel 2: Formulierung für ein Kontaktlinsenmittel

Ein Kontaktlinsenpflegemittel wird durch Zusammenmischen der folgenden Komponenten hergestellt:

Dexpanthenol	10,0 g/l
EDTA	1,0 g/l
Natriumchlorid	7,0 g/l
TRIS Amino	2,5 g/l
PHMB	0,001 g/l
Aqua Purificata	ad 1000 ml

Beispiel 3: Formulierung für ein Kontaktlinsenmittel

Ein Kontaktlinsenpflegemittel wird durch Zusammenmischen der folgenden Komponenten hergestellt:

Dexpanthenol	10,0 g/l
EDTA	0,25 g/l
Natriumchlorid	8,6 g/l
Dinatriumhydrogenphosphat	0,072 g/l
Natriumdihydrogenphosphat	0,622 g/l
PHMB	0,001 g/l
Poloxamer 407	1,0 g/l
Aqua Purificata	ad 1000 ml

12. Jan. 2001

Patentansprüche

1. Kontaktlinsenpflegemittel enthaltend Dexpanthenol.
2. Kontaktlinsenpflegemittel gemäss Anspruch 1, enthaltend eine wässrige Lösung enthaltend 0,5 bis 4 Gewichtsprozent und vorzugsweise 1 bis 3 Gewichtsprozent Dexpanthenol.
3. Kontaktlinsenpflegemittel gemäss Anspruch 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, dass es einen oder mehrere weitere Bestandteile ausgewählt aus der Gruppe Puffersubstanzen, die Tonizität beeinflussende Substanzen, oberflächenaktive Substanzen, die Viskosität beeinflussende Substanzen, Komplexierungsmittel, und antimikrobielle Verbindungen enthält.
4. Kontaktlinsenpflegemittel gemäss einem der Ansprüche 1 bis 3, dadurch gekennzeichnet, dass es Dexpanthenol, eine oder mehrere Puffersubstanzen, PHMB, Kochsalz oder Kalliumchlorid und ein Komplexierungsmittel enthält.
5. Kontaktlinsenpflegemittel gemäss einem der Ansprüche 1 bis 4, dadurch gekennzeichnet, dass es

Dexpanthenol	5 bis 20 g/l
NaCl oder KCl	3 bis 9 g/l
PHMB	0,0005 bis 0,05 g/l
EDTA	0,1 bis 2 g/l

sowie Puffersubstanzen und Wasser enthält und einen pH-Wert von 6 bis 8 aufweist.
6. Kontaktlinsenpflegemittel gemäss Anspruch 5, dadurch gekennzeichnet, dass es zusätzlich eine oberflächenaktive Substanz aufweist.
7. Verwendung eines Kontaktlinsenpflegemittels gemäss einem der Ansprüche 1 bis 6 zur Reinigung und gegebenenfalls Desinfektion einer Kontaktlinse.
8. Verwendung von Dexpanthenol als Bestandteil eines Kontaktlinsenpflegemittels.

- 8 -

9. Verfahren zur Reinigung und gegebenenfalls Desinfektion einer Kontaktlinse, dadurch gekennzeichnet, dass ein Kontaktlinsenpflegemittel gemäss einem der Ansprüche 1 bis 6 1 für eine Zeitspanne mit einer Kontaktlinse in Kontakt gebracht wird, die für eine Reinigung und gegebenenfalls Desinfektion ausreichend ist.

12 Jan. 2001

Zusammenfassung

Die vorliegende Erfindung bezieht sich auf Kontaktlinsenpflegemittel enthaltend Dexpanthenol. Die Erfindung bezieht sich ebenfalls auf die Verwendung eines solchen Kontaktlinsenpflegemittels zur Reinigung und gegebenenfalls Desinfektion von Kontaktlinsen.

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning
Operations and is not part of the Official Record**

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☐ BLACK BORDERS
- ☐ IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- ☐ FADED TEXT OR DRAWING
- ☐ BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING
- ☐ SKEWED/SLANTED IMAGES
- ☐ COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS
- ☐ GRAY SCALE DOCUMENTS
- ☒ LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT
- ☐ REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY
- ☐ OTHER: _____

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.